

**International Provisional  
Examination Report – Supplement**

International File: PCT/EP99/04814

The present decision is related to the following documents cited in the Research Report:

- D1: Csuk, R. et al., *Tetrahedron: Asymmetry*, (1994), **5(2)**, 269 – 76  
D2: Evans, T. et al., *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1*, **5(1)**, (1992), 589 – 592  
D3: Brabban, A. et al., *J. Industrial Microbiology*, (1996), **16(1)**, 8 – 14  
D4: US-A-5 688 933  
D5: WO-A-99 105 19

V.

i. Document D1 discloses a method for preparing optically active 1-acetamido-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid methyl starting from the racemic 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-one. According to D1, the racemic 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-one is converted by (a) chemical hydrolysis (with hydrochloric acid) and (b) esterification (with methanol) and acetylation to racemic 1-acetamido-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid methyl (compound (+/-)-1, page 270). Then, the racemic 1-acetamido-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid methyl is hydrolyzed enantioselectively by a hydrolase (porcine liver esterase or lipase) to yield the optically active isomers.

Document D2 describes the hydrolysis of racemic 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-one by microorganisms of the species *Pseudomonas solanacearum*, whereby optically active (-)-2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-one and optically active (1R-4S)-amino-cyclopent-2-ene-3-carboxylic acid is formed. The latter is hydrolyzed chemically, esterified and acylated to prepare acetyl-amino-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid ester.

Documents D3 – D4 disclose a method for preparing optically active 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-one and 1-amino-cyclopent-2-ene-3-carboxylic acid derivatives starting with racemic 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-one derivatives by means of a lactamase.

Since, in the method according to D1, D2 – D4, the nitrogen atom of 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-one and the optically active 1-acetamido-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid is not protected by an acyl or acyloxy group, the subject of Claims 1 – 11 appears to be novel with respect to D1 – D4. (Art. 33(2) PCT).

ii. The object of invention 1 is seen as an alternative method with respect to D1 – D4 to prepare optically active derivatives of 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-ones and 1-amino-cyclopent-2-ene-3-carboxylic acid C<sub>1-10</sub> alkyl esters.

As neither D1 nor D2 mention a direct conversion of racemic N-substituted 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-one with a hydrolase in the presence of a nucleophile and a base in a constant pH range, the subject of Claims 1 – 11 appears to be inventive with respect to D1 – D2 (Art. 33(3) PCT).

The requirement of inventive activity also appears to be fulfilled for Claims 1 – 11 with respect to D3 and/or D4. Due to the high substrate specificity of lactamases (see D3, page 11: "Substrate Specificity"), the expert would not expect hydrolysis of N-substituted 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-ene-3-ones by lactamases, so that the method according to the application also by D3 and/or D4 is not recommended.

iii. The IPEA shares the opinion of the applicant that the present application also fulfills the requirement of unity. It follows from this that the objection raised on lack of unity will not be maintained further.

VI. With respect to the interim document D5 (published March 4, 1999), it is first assumed that priority is effectively claimed in the present case. However, mention needs to be made at this point that D5 (see claims and all examples) discloses derivatives and their preparation methods, which fall under the wording of Claims 1 – 10, which will possibly be significant in the regional phase (Art. 54(3) EPÜ)

VII. Upon entry into the European Regional Phase, documents D1 – D4 should be cited in the specification to fulfill the requirements of Rule 27.1(b) EPÜ.

## PATENT COOPERATION TREATY

PCT

## NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

Assistant Commissioner for Patents  
United States Patent and Trademark  
Office  
Box PCT  
Washington, D.C. 20231  
ÉTATS-UNIS D'AMÉRIQUE

in its capacity as elected Office

<b>Date of mailing</b> (day/month/year) 28 February 2000 (28.02.00)	
<b>International application No.</b> PCT/EP99/04814	<b>Applicant's or agent's file reference</b> LO7853
<b>International filing date</b> (day/month/year) 08 July 1999 (08.07.99)	<b>Priority date</b> (day/month/year) 09 July 1998 (09.07.98)
<b>Applicant</b> BERNEGGER-EGLI, Christine et al	

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

☒ in the demand filed with the International Preliminary Examining Authority on:

21 January 2000 (21.01.00)

☐ in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:2. The election ☒ was☐ was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

<b>The International Bureau of WIPO</b> 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No.: (41) 221 740.14.35	<b>Authorized officer</b> C. Villet Telephone No.: (41) 221 338.83.48
---	---

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>L07853</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5	
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 99/04814</b>	internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>08/07/1999</b>	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>09/07/1998</b>
Anmelder <b>LONZA AG et. al.</b>		

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 3 Blätter.



Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1. Grundlage des Berichts

- a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.



Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

- b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das



in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.



zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.



bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.



bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.



Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.



Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2.



**Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen** (siehe Feld I).

3.



**Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung** (siehe Feld II).

4. Hinsichtlich der **Bezeichnung der Erfindung**



wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.



wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

5. Hinsichtlich der **Zusammenfassung**



wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt



wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der **Zeichnungen** ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. —



wie vom Anmelder vorgeschlagen



weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.



weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.



keine der Abb.

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C12P41/00 C12P17/10 C12P13/00 C12P13/02 C07C233/52

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C12P C07C

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	CSUK, RENE ET AL: "Biocatalytical transformations. IV. Enantioselective enzymic hydrolyses of building blocks for the synthesis of carbocyclic nucleosides" TETRAHEDRON: ASYMMETRY (1994), 5(2), 269-76, 1994, XP002063687 ✓ das ganze Dokument	1-11
A	EVANS C T ET AL: "POTENTIAL USE OF CARBOCYCLIC NUCLEOSIDES FOR THE TREATMENT OF AIDS CHEMO-ENZYMATIC SYNTHESIS OF THE ENANTIOMERS OF CARBOVIR" JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, PERKIN TRANSACTIONS 1, Nr. 5, 1. Januar 1992 (1992-01-01), Seiten 589-592, XP002089871 ISSN: 0300-922X ✓ das ganze Dokument	1,8,9

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen:

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benützung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

1. November 1999

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

08/11/1999

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. +31-70 340-2040, Fax: 31-70 340-2041  
Fax: +31-70 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Delanghe, L

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	US 5 688 933 A (ROBERTS STANLEY MICHAEL ET AL) 18. November 1997 (1997-11-18) Spalte 3; Ansprüche ✓	1,8,9
A	WO 98 10075 A (CHIROSCIENCE LTD) 12. März 1998 (1998-03-12) ✓ Ansprüche	1
A	BRABBAN A ET AL: "STEREOSPECIFIC GAMMA-LACTAMASE ACTIVITY IN A PSEUDOMONAS FLUORESCENS SPECIES" JOURNAL OF INDUSTRIAL MICROBIOLOGY, Bd. 16, Nr. 1, 1. Januar 1996 (1996-01-01), Seiten 8-14, XP002048090 ISSN: 0169-4146 ✓ das ganze Dokument	1
A	TAYLOR S J C ET AL: "DEVELOPMENT OF THE BIOCATALYTIC RESOLUTION OF 2 -AZABICYCLO 2.2.1HEPT-5-EN-3-ONE AS AN ENTRY TO SINGLE -ENANTIOMERCARBOCYCLIC NUCLEOSIDES" TETRAHEDRON: ASYMMETRY, Bd. 4, Nr. 6, 1. Januar 1993 (1993-01-01), Seiten 1117-1128, XP002041316 ISSN: 0957-4166 ✓ das ganze Dokument	1
P, X	WO 99 10519 A (DAWSON MICHAEL JOHN ; WALLIS CHRISTOPHER JOHN (GB); GLAXO GROUP LTD) ✓ 4. März 1999 (1999-03-04) das ganze Dokument	1-11

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/04814

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5688933 A	18-11-1997	US 5498625 A	12-03-1996
		AT 118208 T	15-02-1995
		DE 69016739 D	23-03-1995
		DE 69016739 T	14-06-1995
		DK 424064 T	26-06-1995
		EP 0424064 A	24-04-1991
		ES 2067693 T	01-04-1995
		GR 3015887 T	31-07-1995
		JP 2648013 B	27-08-1997
		JP 3218380 A	25-09-1991
		US 5284769 A	08-02-1996
WO 9810075 A	12-03-1998	AU 4123897 A	26-03-1998
		EP 0925361 A	30-06-1999
		ZA 9707912 A	03-09-1998
WO 9910519 A	04-03-1999	AU 9738698 A	16-03-1999

09/743391  
Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference LO7853	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP99/04814	International filing date ( <i>day month year</i> ) 08 July 1999 (08.07.99)	Priority date ( <i>day month year</i> ) 09 July 1998 (09.07.98)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C12P 41/00, 17/10, 13/00, 13/02, C07C 233/52		
Applicant LONZA AG		

<p>1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>5</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p><input type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).</p> <p>These annexes consist of a total of _____ sheets.</p>
<p>3. This report contains indications relating to the following items:</p> <p>I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report</p> <p>II <input type="checkbox"/> Priority</p> <p>III <input type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p>IV <input type="checkbox"/> Lack of unity of invention</p> <p>V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability: citations and explanations supporting such statement</p> <p>VI <input checked="" type="checkbox"/> Certain documents cited</p> <p>VII <input type="checkbox"/> Certain defects in the international application</p> <p>VIII <input checked="" type="checkbox"/> Certain observations on the international application</p>

Date of submission of the demand 21 January 2000 (21.01.00)	Date of completion of this report 15 September 2000 (15.09.2000)
Name and mailing address of the IPEA EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.



# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/04814

## I. Basis of the report

1. This report has been drawn on the basis of (*Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to the report since they do not contain amendments*).

- ☒ the international application as originally filed.
- ☒ the description. pages 1-16 , as originally filed.  
 pages \_\_\_\_\_ , filed with the demand.  
 pages \_\_\_\_\_ , filed with the letter of \_\_\_\_\_ .  
 pages \_\_\_\_\_ , filed with the letter of \_\_\_\_\_ .
- ☒ the claims. Nos. 1-11 , as originally filed.  
 Nos. \_\_\_\_\_ , as amended under Article 19.  
 Nos. \_\_\_\_\_ , filed with the demand.  
 Nos. \_\_\_\_\_ , filed with the letter of \_\_\_\_\_ .  
 Nos. \_\_\_\_\_ , filed with the letter of \_\_\_\_\_ .
- ☐ the drawings. sheets/fig \_\_\_\_\_ , as originally filed.  
 sheets/fig \_\_\_\_\_ , filed with the demand.  
 sheets/fig \_\_\_\_\_ , filed with the letter of \_\_\_\_\_ .  
 sheets/fig \_\_\_\_\_ , filed with the letter of \_\_\_\_\_ .

2. The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description. pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims. Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings. sheets/fig \_\_\_\_\_

3. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

4. Additional observations, if necessary:

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.  
PCT/EP 99/04814

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability: citations and explanations supporting such statement

### 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-11	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-11	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-11	YES
	Claims		NO

### 2. Citations and explanations

This preliminary examination report refers to the following search report citations:

- D1: Csuk, R. et al., *Tetrahedron: Asymmetry*, (1994), **5(2)**, 269-76
- D2: Evans, T. et al., *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1*, **5(1)**, (1992), 589-592
- D3: Brabban, A., et al., *J. Industrial Microbiology*, (1996), **16(1)**, 8-14
- D4: US-A-5 688 933
- D5: WC-A-99/10519

1. Document D1 discloses a process for preparing optically active 1-acetamido-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid methyl from the racemic 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one. According to D1, the racemic 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one is reacted by (a) chemical hydrolysis (with hydrochloric acid) and (b) esterification (with methanol) and acetylation to form a racemic 1-acetamido-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid methyl (compound (+)-1, page 270).  
The racemic 1-acetamido-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid methyl is subsequently hydrolysed enantioselectively by a hydrolase porcine liver

esterase or lipase), thereby obtaining the optically active isomers.

Document D2 describes the hydrolysis of racemic 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one using microorganisms of the species *Pseudomonas solanacearum*, as a result of which optically active (-)-2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one and optically active (1R,4S)-amino-cyclopent-2-ene-3-carboxylic acid is formed. The latter is chemically hydrolysed, esterified and acylated in order to prepare the acetyl amino cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid ester.

Documents D3 and D4 disclose processes for preparing optically active 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one and 1-amino-cyclopent-2-ene-3-carboxylic acid derivatives from racemic 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one derivatives using a lactamase.

Since in the processes according to D1 and D2-D4, the nitrogen atom is not protected by means of an acyl- or acyloxy protective group in either 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one or the optically active 1-acetamido-cyclopent-2-ene-1-carboxylic acid, the subject matter of Claims 1-11 appears to be novel over D1-D4 (PCT Article 33(2)).

- ii. The problem addressed by invention 1 can be regarded as that of devising an alternative process to those of D1-D4 for preparing optically active derivatives of 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one and 1-amino-cyclopent-2-ene-3-carboxylic acid-3,4,4-alkyl esters.

The subject matter of Claims 1-11 appears to be

inventive when compared with D1 and D2 (PCT Article 33(3)), since neither D1 nor D2 suggests the direct reaction of racemic N-substituted 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one with a hydrolase in the presence of a nucleophile and a base within a constant pH range.

Claims 1-11 also appear to meet the requirement for inventive step when compared with D3 and/or D4, since owing to the high substrate specificity of the lactamases (see D3, page 11: 'substrate specificity'), it was not obvious for a person skilled in the art to carry out hydrolysis of N-substituted 2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one using lactamases. Consequently, the process according to the application has not been suggested by D3 and/or D4 either.

- iii. The IPEA shares the applicant's view that the present application also meets the requirement for unity of invention. Consequently, the objection raised regarding a lack of unity of invention is withdrawn.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 99/04814

## Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: Box VI

With respect to the intermediate document D5 (published on 4 March 1999), it has been assumed that the priority has been claimed correctly in the present instance. However, it may be pointed out at this stage that D5 (see claims and all the examples) disclose derivatives and their processes of preparation that come under the wording of Claims 1-10, which could possibly be of significance in the regional phase (EPC Article 54(3)).

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 99/04814

## VIII. Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

Should the application enter the European regional phase, the applicant should indicate documents D1-D4 in the description in order to comply with the requirements of EPC Rule 27.1(b).

ak

PCT

18. Sep. 2000 LC

MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERSENDUNG  
DES INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN  
PRÜFUNGSBERICHTS  
(Regel 71.1 PCT)

15.09.2000

## WICHTIGE MITTEILUNG

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)  
09/07/1998

LONZA AG et. al.

1. Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß ihm die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde hiermit den zu der internationalen Anmeldung erstellten internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen, übermittelt.
2. Eine Kopie des Berichts wird - gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen - dem Internationalen Büro zur Weiterleitung an alle ausgewählten Ämter übermittelt.
3. Auf Wunsch eines ausgewählten Amtes wird das Internationale Büro eine Übersetzung des Berichts (jedoch nicht der Anlagen) ins Englische anfertigen und diesem Amt übermitteln.

#### 4. ERINNERUNG

Ist einem ausgewählten Amt eine Übersetzung der internationalen Anmeldung zu übermitteln, so muß diese Übersetzung auch Übersetzungen aller Anlagen zum internationalen vorläufigen Prüfungsbericht enthalten. Es ist Aufgabe des Anmelders, solche Übersetzungen anzufertigen und den betroffenen ausgewählten Ämtern direkt zuzuleiten.

Weitere Einzelheiten zu den maßgebenden Fristen und Erfordernissen der ausgewählten Ämter sind Band II des PCT-Leitfadens für Anmelder zu entnehmen.

Tel +49 89 2399-8101



# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT


(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts LO7853	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsbericht (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/04814	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 08/07/1999	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Tag) 09/07/1998
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C12P41/00		
Anmelder LONZA AG et. al.		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationale vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
- ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).
- Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderische Tätigkeit und der gewerbliche Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☒ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☒ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  21/01/2000	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  15.09.2000
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx 523656 epmu d Fax +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Romano-Götsch, R  Tel. Nr. +49 89 2399 8874





# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/04814

## I. Grundlage des Berichts

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten.*):

### Beschreibung, Seiten:

1-16                      ursprüngliche Fassung

### Patentansprüche, Nr.:

1-11                      ursprüngliche Fassung

2. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung,              Seiten:  
☐ Ansprüche,                Nr.:  
☐ Zeichnungen,              Blatt:

3. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)):

4. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

## V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

### 1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 1-11 Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche 1-11 Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche 1-11 Nein: Ansprüche

### 2. Unterlagen und Erklärungen

siehe Beiblatt

**VI. Bestimmte angeführte Unterlagen**

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)  
und / oder
2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

**siehe Beiblatt**

**VIII. Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung**

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken:

**siehe Beiblatt**

Der vorliegende Bescheid bezieht sich auf die folgenden, im Recherchenbericht zitierten Dokumente:

- D1: Csuk, R. et al, *Tetrahedron: Asymmetry*, (1994), **5(2)**, 269-76  
D2: Evans, T. et al., *J.Chem. Soc. Perkin Trans. 1*, **5(1)**, (1992), 589-592  
D3: Brabban, A., et al., *J. Industrial Microbiology*, (1996), **16(1)**, 8-14  
D4: US-A-5 688 933  
D5: WO-A-99 10519

V.

- i. Dokument D1 offenbart ein Verfahren zu Herstellung von optisch aktiven 1-Acetamido-cyclopent-2-en-1-carbonsäuremethyl ausgehend von den racemischen 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on. Laut D1, wird der racemische 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on durch (a) chemische Hydrolyse (mit Salzsäure) und (b) Veresterung (mit Methanol) und Acetylierung zum racemischen 1-Acetamido-cyclopent-2-en-1-carbonsäuremethyl (Verbindung ( $\pm$ )-1, S. 270) verwandelt. Anschließend wird der racemische 1-Acetamido-cyclopent-2-en-1-carbonsäuremethyl durch eine Hydrolase (Porcine Liver Esterase oder Lipase) enantioselektiv hydrolysiert, wobei die optisch aktiven Isomeren erhalten werden.

Dokument D2 beschreibt die Hydrolyse von racemischem 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on mittels Mikroorganismen der Spezies *Pseudomonas solanacearum*, wobei optisch aktives optisch aktives (-)-2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on und optisch aktive (1R-4S)-Amino-cyclopent-2-en-3-carbonsäure gebildet wird. Letztes wird zur Herstellung des Acetyl amino cyclopent-2-en-1-carbonsäureesters chemisch hydrolysiert, verestert und acyliert.

Dokumente D3-D4 offenbaren ein Verfahren zur Herstellung von optisch aktiven 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on und 1-Amino-cyclopent-2-en-3-carbonsäure Derivate ausgehend von racemischen 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on Derivate mittels einer Lactamase.

Da im Verfahren gemäß D1, D2-D4 weder der 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on noch der optisch aktiv 1-Acetamido-cyclopent-2-en-1-carbonsäure das Stickstoffatom mittels einer Acyl- oder Acyloxy Schutzgruppe geschützt ist. Aus diesem Grund, scheint der Gegenstand der Ansprüche 1-11 neu gegenüber D1-D4 zu sein (Art. 33(2) PCT).

- ii. Die Aufgabe der Erfindung 1 ist darin zu sehen, ein alternatives Verfahren gegenüber D1-D4 bereitzustellen um optisch aktive Derivate von 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-3-one und 1-Amino-cyclopent-2-en-3-carbonsäureC<sub>1-10</sub>alkylester herzustellen.

Da weder D1 noch D2 auf einer direkten Umsetzung von racemischen N-substituierten 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on mit einer Hydrolase in Gegenwart eines Nukleophils und einer Base in einem konstanten pH-Bereich hinweisen, scheint der Gegenstand der Ansprüche 1-11 erfinderisch gegenüber D1-D2 zu sein (Art. 33(3) PCT).

Das Erfordernis der erfinderischen Tätigkeit gegenüber D3 und/oder D4 für die Ansprüche 1-11 scheint auch erfüllt zu sein. Denn aufgrund der hohen Substratspezifität der Lactamasen (siehe D3, S. 11: 'Substrate Specificity'), war eine Hydrolyse N-substituierter 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-3-one durch Lactamasen für den Fachmann nicht zu erwarten, so daß das Verfahren gemäß Anmeldung auch durch D3 und/oder D4 nicht nahegelegt wird.

- iii. Die IPEA teilt die Meinung der Anmelderin, wonach die vorliegende Anmeldung auch das Erfordernis der Einheitlichkeit erfüllt. Daraus folgt, daß der erhobene Einwand der mangelnden Einheitlichkeit nicht weiterhin aufrecht erhalten wird.

- VI. Bezüglich des Zwischendokument D5 (veröffentlicht am 04.03.99) wird zunächst davon angegangen, daß die Priorität im vorliegenden Fall wirksam beansprucht ist. Es wird jedoch bereits jetzt darauf hingewiesen, daß D5 (siehe Ansprüche und sämtliche Beispiele) Derivate und deren Herstellungsverfahren offenbart, die unter den Anspruchswortlaut der Ansprüche 1-10 fallen, was möglicherweise in der regionalen Phase (Art. 54(3) EPÜ) von Bedeutung sein wird.

- VII. Beim Eintritt in der Europäischen Regionalen Phase, sollten die Dokumente D1-D4 in der Beschreibung genannt werden um die Erfordernisse der Regel 27.1(b) EPÜ zu erfüllen.

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

REC'D 19 SEP 2000

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

T 17



Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts LO7853	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsbericht (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/04814	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 08/07/1999	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Tag) 09/07/1998
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C12P41/00		
Anmelder LONZA AG et. al.		

- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationale vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
  - ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderische Tätigkeit und der gewerbliche Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☒ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☒ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  21/01/2000	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  15.09.2000
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Romano-Götsch, R  Tel. Nr. +49 89 2399 8874  

**I. Grundlage des Berichts**

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten.*):

**Beschreibung, Seiten:**

1-16                      ursprüngliche Fassung

**Patentansprüche, Nr.:**

1-11                      ursprüngliche Fassung

2. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung,              Seiten:  
☐ Ansprüche,                Nr.:  
☐ Zeichnungen,              Blatt:

3. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)):

4. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

**V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

**1. Feststellung**

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche	1-11
	Nein: Ansprüche	
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche	1-11
	Nein: Ansprüche	
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche	1-11
	Nein: Ansprüche	

**2. Unterlagen und Erklärungen**

**siehe Beiblatt**

**VI. Bestimmte angeführte Unterlagen**

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)

und / oder

2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

**siehe Beiblatt**

**VIII. Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung**

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken:

**siehe Beiblatt**

Der vorliegende Bescheid bezieht sich auf die folgenden, im Recherchenbericht zitierten Dokumente:

- D1: Csuk, R. et al, *Tetrahedron: Asymmetry*, (1994), **5(2)**, 269-76  
D2: Evans, T. et al., *J.Chem. Soc. Perkin Trans. 1*, **5(1)**, (1992), 589-592  
D3: Brabban, A., et al., *J. Industrial Microbiology*, (1996), **16(1)**, 8-14  
D4: US-A-5 688 933  
D5: WO-A-99 10519

V.

- i. Dokument D1 offenbart ein Verfahren zu Herstellung von optisch aktiven 1-Acetamido-cyclopent-2-en-1-carbonsäuremethyl ausgehend von den racemischen 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on. Laut D1, wird der racemische 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on durch (a) chemische Hydrolyse (mit Salzsäure) und (b) Veresterung (mit Methanol) und Acetylierung zum racemischen 1-Acetamido-cyclopent-2-en-1-carbonsäuremethyl (Verbindung ( $\pm$ )-1, S. 270) verwandelt. Anschließend wird der racemische 1-Acetamido-cyclopent-2-en-1-carbonsäuremethyl durch eine Hydrolase (Porcine Liver Esterase oder Lipase) enantioselektiv hydrolysiert, wobei die optisch aktiven Isomeren erhalten werden.

Dokument D2 beschreibt die Hydrolyse von racemischem 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on mittels Mikroorganismen der Spezies *Pseudomonas solanacearum*, wobei optisch aktives optisch aktives (-)-2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on und optisch aktive (1R-4S)-Amino-cyclopent-2-en-3-carbonsäure gebildet wird. Letztes wird zur Herstellung des Acetyl amino cyclopent-2-en-1-carbonsäureesters chemisch hydrolysiert, verestert und acyliert.

Dokumente D3-D4 offenbaren ein Verfahren zur Herstellung von optisch aktiven 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on und 1-Amino-cyclopent-2-en-3-carbonsäure Derivate ausgehend von racemischen 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on Derivate mittels einer Lactamase.

Da im Verfahren gemäß D1, D2-D4 weder der 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on noch der optisch aktiv 1-Acetamido-cyclopent-2-en-1-carbonsäure das Stickstoffatom mittels eines Acyl- oder Acyloxy Schutzgruppe geschützt ist. Aus diesem Grund, scheint der Gegenstand der Ansprüche 1-11 neu gegenüber D1-D4 zu sein (Art. 33(2) PCT).



- ii. Die Aufgabe der Erfindung 1 ist darin zu sehen, ein alternatives Verfahren gegenüber D1-D4 bereitzustellen um optisch aktive Derivate von 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-3-one und 1-Amino-cyclopent-2-en-3-carbonsäure $C_{1-10}$ alkylester herzustellen.

Da weder D1 noch D2 auf einer direkten Umsetzung von racemischen N-substituierten 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on mit einer Hydrolase in Gegenwart eines Nukleophils und einer Base in einem konstanten pH-Bereich hinweisen, scheint der Gegenstand der Ansprüche 1-11 erfinderisch gegenüber D1-D2 zu sein (Art. 33(3) PCT).

Das Erfordernis der erfinderischen Tätigkeit gegenüber D3 und/oder D4 für die Ansprüche 1-11 scheint auch erfüllt zu sein. Denn aufgrund der hohen Substratspezifität der Lactamasen (siehe D3, S. 11: 'Substrate Specificity'), war eine Hydrolyse N-substituierten 2-Azabicyclo[2.2.1]hept-5-3-one durch Lactamasen für den Fachmann nicht zu erwarten, so daß das Verfahren gemäß Anmeldung auch durch D3 und/oder D4 nicht nahegelegt wird.

- iii. Die IPEA teilt die Meinung der Anmelderin, wonach die vorliegende Anmeldung auch das Erfordernis der Einheitlichkeit erfüllt. Daraus folgt, daß der erhobenen Einwand der mangelnden Einheitlichkeit nicht weiterhin aufrecht erhalten wird.
- VI. Bezüglich das Zwischendokument D5 (veröffentlicht am 04.03.99) wird zunächst davon angegangen, daß die Priorität im vorliegendem Fall wirksam beansprucht ist. Es wird jedoch bereits jetzt darauf hingewiesen, daß D5 (siehe Ansprüche und sämtliche Beispiele) Derivate und deren Herstellungsverfahren offenbart, die unter den Anspruchswortlaut der Ansprüche 1-10 fallen, was möglicherweise in der regionalen Phase (Art. 54(3) EPÜ) von Bedeutung sein wird.
- VII. Beim Eintritt in der Europäischen Regionalen Phase, sollten die Dokumente D1-D4 in der Beschreibung genannt werden um die Erfordernisse der Regel 27.1(b) EPÜ zu erfüllen.

PCT

ANTRAG

Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird.

Vom Anmeldeamt auszufüllen

Internationales Aktenzeichen

Internationales Anmeldedatum

Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts (falls gewünscht)  
(max. 12 Zeichen) L07853

Feld Nr. I BEZEICHNUNG DER ERFINDUNG

Verfahren zur Herstellung von (1R,4S)-2-Azabicyclo [ 2.2.1 ] hept-5-en-3-on-Derivaten

Feld Nr. II ANMELDER

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

LONZA AG  
Münchensteinerstrasse 38  
CH-4052 Basel  
Schweiz

☐ Diese Person ist gleichzeitig Erfinder

Telefonnr.:

Telefaxnr.:

Fernschreibnr.:

Staatsangehörigkeit (Staat):  
CH

Sitz oder Wohnsitz (Staat):  
CH

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten: ☐ alle Bestimmungsstaaten ☒ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika ☐ nur die Vereinigten Staaten von Amerika ☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

Feld Nr. III WEITERE ANMELDER UND/ODER (WEITERE) ERFINDER

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

✓ BERNEGGER-EGLI, Christine  
Bahnhofstrasse  
CH-3985 Münster  
Schweiz

Diese Person ist:

☐ nur Anmelder

☒ Anmelder und Erfinder

☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)

Staatsangehörigkeit (Staat):  
CH

Sitz oder Wohnsitz (Staat):  
CH

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten: ☐ alle Bestimmungsstaaten ☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika ☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika ☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

☒ Weitere Anmelder und/oder (weitere) Erfinder sind auf einem Fortsetzungsblatt angegeben.

Feld Nr. IV ANWALT ODER GEMEINSAMER VERTRETER; ODER ZUSTELLANSCHRIFT

Die folgende Person wird hiermit bestellt/ist bestellt worden, um für den (die) Anmelder vor den zuständigen internationalen Behörden in folgender Eigenschaft zu handeln als: ☒ Anwalt ☐ gemeinsamer Vertreter

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben.)

Dr. Wolfgang RITTHALER  
WINTER, BRANDL & PARTNER (Zusammenschluß Nr.5)  
Alois-Steinecker-Str. 22  
D-85354 Freising  
Deutschland

Telefonnr.:

08161/930-0

Telefaxnr.:

08161/930-100

Fernschreibnr.:

☐ Zustellanschrift: Dieses Kästchen ist anzukreuzen, wenn kein Anwalt oder gemeinsamer Vertreter bestellt ist und statt dessen im obigen Feld eine spezielle Zustellanschrift angegeben ist.

## Fortsetzung von Feld Nr. III WEITERE ANMELDER UND/ODER (WEITERE) ERFINDER

*Wird keines der folgenden Felder benutzt, so sollte dieses Blatt dem Antrag nicht beigelegt werden.*

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

BRUX, Frank  
Haus Formes  
CH-3942 Raron  
Schweiz

Diese Person ist:

☐ nur Anmelder

☒ Anmelder und Erfinder

☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)

Staatsangehörigkeit (Staat):

CH

Sitz oder Wohnsitz (Staat):

CH

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten:

☐ alle Bestimmungsstaaten

☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika

☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika

☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

RODUIT, Jean Paul  
Loos  
CH-3979 Grône  
Schweiz

Diese Person ist:

☐ nur Anmelder

☒ Anmelder und Erfinder

☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)

Staatsangehörigkeit (Staat):

CH

Sitz oder Wohnsitz (Staat):

CH

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten:

☐ alle Bestimmungsstaaten

☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika

☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika

☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

WERBITZKY, Oleg  
Terbinerstrasse 12  
CH-3939 Visp  
Schweiz

Diese Person ist:

☐ nur Anmelder

☒ Anmelder und Erfinder

☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)

Staatsangehörigkeit (Staat):

DE

Sitz oder Wohnsitz (Staat):

CH

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten:

☐ alle Bestimmungsstaaten

☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika

☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika

☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

GUGGISBERG, Yves  
Avenue du Rothorn 11  
CH-3060 Sierre  
Schweiz

Diese Person ist:

☐ nur Anmelder

☒ Anmelder und Erfinder

☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)

Staatsangehörigkeit (Staat):

CH

Sitz oder Wohnsitz (Staat):

CH

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten:

☐ alle Bestimmungsstaaten

☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika

☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika

☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

☐ Weitere Anmelder und/oder (weitere) Erfinder sind auf einem zusätzlichen Fortsetzungsblatt angegeben

## Feld Nr. V BESTIMMUNG VON STAATEN

Die folgenden Bestimmungen nach Regel 4.9 Absatz a werden hiermit vorgenommen (bitte die entsprechenden Kästchen ankreuzen; wenigstens ein Kästchen muß angekreuzt werden):

## Regionales Patent

- ☒ AP ARIPO-Patent: GH Ghana, GM Gambia, KE Kenia, LS Lesotho, MW Malawi, SD Sudan, SZ Swasiland, UG Uganda, ZW Simbabwe und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Harare-Protokolls und des PCT ist
- ☒ EA Eurasisches Patent: AM Armenien, AZ Aserbaidschan, BY Belarus, KG Kirgisistan, KZ Kasachstan, MD Republik Moldau, RU Russische Föderation, TJ Tadschikistan, TM Turkmenistan und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Eurasischen Patentübereinkommens und des PCT ist
- ☒ EP Europäisches Patent: AT Österreich, BE Belgien, CH und LI Schweiz und Liechtenstein, CY Zypern, DE Deutschland, DK Dänemark, ES Spanien, FI Finnland, FR Frankreich, GB Vereinigtes Königreich, GR Griechenland, IE Irland, IT Italien, LU Luxemburg, MC Monaco, NL Niederlande, PT Portugal, SE Schweden und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Europäischen Patentübereinkommens und des PCT ist
- ☒ OA OAPI-Patent: BF Burkina Faso, BJ Benin, CF Zentralafrikanische Republik, CG Kongo, CI Côte d'Ivoire, CM Kamerun, GA Gabun, GN Guinea, GW Guinea-Bissau, ML Mali, MR Mauretanien, NE Niger, SN Senegal, TD Tschad, TG Togo und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat der OAPI und des PCT ist (falls eine andere Schutzrechtsart oder ein sonstiges Verfahren gewünscht wird, bitte auf der gepunkteten Linie angeben) .....

## Nationales Patent (falls eine andere Schutzrechtsart oder ein sonstiges Verfahren gewünscht wird, bitte auf der gepunkteten Linie angeben):

- |  |  |
|--|--|
| <input checked="" type="checkbox"/> AL Albanien                          | <input checked="" type="checkbox"/> LS Lesotho   |
| <input checked="" type="checkbox"/> AM Armenien                          | <input checked="" type="checkbox"/> LT Litauen   |
| <input checked="" type="checkbox"/> AT Österreich                        | <input checked="" type="checkbox"/> LU Luxemburg                                       |
| <input checked="" type="checkbox"/> AU Australien                        | <input checked="" type="checkbox"/> LV Lettland  |
| <input checked="" type="checkbox"/> AZ Aserbaidschan                     | <input checked="" type="checkbox"/> MD Republik Moldau                                 |
| <input checked="" type="checkbox"/> BA Bosnien-Herzegowina               | <input checked="" type="checkbox"/> MG Madagaskar                                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> BB Barbados                          | <input checked="" type="checkbox"/> MK Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien |
| <input checked="" type="checkbox"/> BG Bulgarien                         | <input checked="" type="checkbox"/> MN Mongolei  |
| <input checked="" type="checkbox"/> BR Brasilien                         | <input checked="" type="checkbox"/> MW Malawi  |
| <input checked="" type="checkbox"/> BY Belarus                           | <input checked="" type="checkbox"/> MX Mexiko  |
| <input checked="" type="checkbox"/> CA Kanada                            | <input checked="" type="checkbox"/> NO Norwegen  |
| <input checked="" type="checkbox"/> CH und LI Schweiz und Liechtenstein  | <input checked="" type="checkbox"/> NZ Neuseeland                                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> CN China                             | <input checked="" type="checkbox"/> PL Polen   |
| <input checked="" type="checkbox"/> CU Kuba                              | <input checked="" type="checkbox"/> PT Portugal  |
| <input checked="" type="checkbox"/> CZ Tschechische Republik             | <input checked="" type="checkbox"/> RO Rumänien  |
| <input checked="" type="checkbox"/> DE Deutschland                       | <input checked="" type="checkbox"/> RU Russische Föderation                            |
| <input checked="" type="checkbox"/> DK Dänemark                          | <input checked="" type="checkbox"/> SD Sudan   |
| <input checked="" type="checkbox"/> EE Estland                           | <input checked="" type="checkbox"/> SE Schweden  |
| <input checked="" type="checkbox"/> ES Spanien                           | <input checked="" type="checkbox"/> SG Singapur  |
| <input checked="" type="checkbox"/> FI Finnland                          | <input checked="" type="checkbox"/> SI Slowenien                                       |
| <input checked="" type="checkbox"/> GB Vereinigtes Königreich            | <input checked="" type="checkbox"/> SK Slowakei  |
| <input checked="" type="checkbox"/> GD Grenada                           | <input checked="" type="checkbox"/> SL Sierra Leone                                    |
| <input checked="" type="checkbox"/> GE Georgien                          | <input checked="" type="checkbox"/> TJ Tadschikistan                                   |
| <input checked="" type="checkbox"/> GH Ghana                             | <input checked="" type="checkbox"/> TM Turkmenistan                                    |
| <input checked="" type="checkbox"/> GM Gambia                            | <input checked="" type="checkbox"/> TR Türkei  |
| <input checked="" type="checkbox"/> HR Kroatien                          | <input checked="" type="checkbox"/> TT Trinidad und Tobago                             |
| <input checked="" type="checkbox"/> HU Ungarn                            | <input checked="" type="checkbox"/> UA Ukraine   |
| <input checked="" type="checkbox"/> ID Indonesien                        | <input checked="" type="checkbox"/> UG Uganda  |
| <input checked="" type="checkbox"/> IL Israel                            | <input checked="" type="checkbox"/> US Vereinigte Staaten von Amerika                  |
| <input checked="" type="checkbox"/> IN Indien                            |  |
| <input checked="" type="checkbox"/> IS Island                            | <input checked="" type="checkbox"/> UZ Usbekistan                                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> JP Japan                             | <input checked="" type="checkbox"/> VN Vietnam   |
| <input checked="" type="checkbox"/> KE Kenia                             | <input checked="" type="checkbox"/> YU Jugoslawien                                     |
| <input checked="" type="checkbox"/> KG Kirgisistan                       | <input checked="" type="checkbox"/> ZW Simbabwe  |
| <input checked="" type="checkbox"/> KP Demokratische Volksrepublik Korea |  |
| <input checked="" type="checkbox"/> KR Republik Korea                    |  |
| <input checked="" type="checkbox"/> KZ Kasachstan                        |  |
| <input checked="" type="checkbox"/> LC Saint Lucia                       | <input checked="" type="checkbox"/> AE Vereinigte Arabische Emirate                    |
| <input checked="" type="checkbox"/> LK Sri Lanka                         | <input checked="" type="checkbox"/> ZA Südafrika                                       |
| <input checked="" type="checkbox"/> LR Liberia                           | <input type="checkbox"/>   |

Kästchen für die Bestimmung von Staaten (für die Zwecke eines nationalen Patents), die dem PCT nach der Veröffentlichung dieses Formblatts beigetreten sind:

Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen: Zusätzlich zu den oben genannten Bestimmungen nimmt der Anmelder nach Regel 4.9 Absatz b auch alle anderen nach dem PCT zulässigen Bestimmungen vor mit Ausnahme der im Zusatzfeld genannten Bestimmungen, die von dieser Erklärung ausgenommen sind. Der Anmelder erklärt, daß diese zusätzlichen Bestimmungen unter dem Vorbehalt einer Bestätigung stehen und jede zusätzliche Bestimmung, die vor Ablauf von 15 Monaten ab dem Prioritätsdatum nicht bestätigt wurde, nach Ablauf dieser Frist als vom Anmelder zurückgenommen gilt. (Die Bestätigung einer Bestimmung erfolgt durch die Entschaltung einer Mitteilung, in der diese Bestimmung angegeben wird, und die Zahlung der Bestimmungen, und der Bestätigungsgeldes. Die Bestätigung muß vom Anmelder am ersten und letzten Tag des 15. Monats eingereicht werden.)

Feld Nr. VI PRIORITÄTSANSPRUCH		<input type="checkbox"/> Weitere Prioritätsansprüche sind im Zusatzfeld angegeben.		
Anmeldedatum der früheren Anmeldung (Tag/Monat/Jahr)	Aktenzeichen der früheren Anmeldung	Ist die frühere Anmeldung eine:		
		nationale Anmeldung: Staat	regionale Anmeldung: regionales Amt	internationale Anmeldung: Anmeldeamt
Zeile (1) 09. Juli 1998 (09.07.1998)	98112719.4 ✓		EPA	
Zeile (2) 17. Dezember 1998 (17.12.1998)	98123949.4 ✓		EPA	
Zeile (3)				

☐ Das Anmeldeamt wird ersucht, eine beglaubigte Abschrift der oben in der (den) Zeile(n) bezeichneten früheren Anmeldung(en) zu erstellen und dem internationalen Büro zu übermitteln (nur falls die frühere Anmeldung(en) bei dem Amt eingereicht worden ist(sind), das für die Zwecke dieser internationalen Anmeldung Anmeldeamt ist)

\* Falls es sich bei der früheren Anmeldung um eine ARIPO-Anmeldung handelt, so muß in dem Zusatzfeld mindestens ein Staat angegeben werden, der Mitgliedsstaat der Pariser Verbandsvereinbarung zum Schutz des gewerblichen Eigentums ist und für den die frühere Anmeldung eingereicht wurde.

### Feld Nr. VII INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE

Wahl der internationalen Recherchenbehörde (ISA)  
(falls zwei oder mehr als zwei internationale Recherchenbehörden für die Ausführung der internationalen Recherche zuständig sind, geben Sie die von Ihnen gewählte Behörde an; der Zweibuchstaben-Code kann benutzt werden):

ISA /

Antrag auf Nutzung der Ergebnisse einer früheren Recherche; Bezugnahme auf diese frühere Recherche (falls eine frühere Recherche bei der internationalen Recherchenbehörde beantragt oder von ihr durchgeführt worden ist):

Datum (Tag/Monat/Jahr)      Aktenzeichen      Staat (oder regionales Amt)

### Feld Nr. VIII KONTROLLISTE; EINREICHUNGSSPRACHE

Diese internationale Anmeldung enthält die folgende Anzahl von Blättern:

Antrag : 5  
Beschreibung (ohne Sequenzprotokollteil) : 16  
Ansprüche : 3  
Zusammenfassung : 1  
Zeichnungen  
Sequenzprotokollteil der Beschreibung  
Blattzahl insgesamt : 25

Dieser internationalen Anmeldung liegen die nachstehend angekreuzten Unterlagen bei:

- ☒ Blatt für die Gebührenberechnung
- ☐ Gesonderte unterzeichnete Vollmacht
- ☐ Kopie der allgemeinen Vollmacht; Aktenzeichen (falls vorhanden):
- ☐ Begründung für das Fehlen einer Unterschrift
- ☐ Prioritätsbeleg(e), in Feld Nr. VI durch folgende Zeilennummer gekennzeichnet:
- ☐ Übersetzung der internationalen Anmeldung in die folgende Sprache:
- ☐ Gesonderte Angaben zu hinterlegten Mikroorganismen oder anderem biologischen Material
- ☐ Protokoll der Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzen in computerlesbarer Form
- ☐ Sonstige (einzeln auflisten):

Abbildung der Zeichnungen, die mit der Zusammenfassung veröffentlicht werden soll (Nr.):

Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht wird:

deutsch

### Feld Nr. IX UNTERSCHRIFT DES ANMELDERS ODER DES ANWALTS

Der Name jeder unterzeichnenden Person ist neben der Unterschrift zu wiederholen, und es ist anzugeben, sofern sich dies nicht eindeutig aus dem Antrag ergibt, in welcher Eigenschaft die Person unterzeichnet.

07. Juli 1999

Dr. Cornelia Stoppkotte

Vom Anmeldeamt auszufüllen

1. Datum des tatsächlichen Eingangs dieser internationalen Anmeldung:	2. Zeichnungen <input type="checkbox"/> eingegangen:  <input type="checkbox"/> nicht eingegangen:
3. Geändertes Eingangsdatum aufgrund nachträglich, jedoch fristgerecht eingegangener Unterlagen oder Zeichnungen zur Vervollständigung dieser internationalen Anmeldung:	
4. Datum des fristgerechten Eingangs der angeforderten Richtigstellungen nach Artikel 11(2) PCT:	
5. Internationale Recherchenbehörde (falls zwei oder mehr zuständig sind): ISA /	6. <input type="checkbox"/> Übermittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchegebühr aufgeschoben

Vom Internationalen Büro auszufüllen

Datum des Eingangs des Aktenexemplars beim Internationalen Büro:
--

**Zusatzfeld** Wird dieses Zusatzfeld nicht benutzt, so sollte dieses Blatt dem Antrag nicht beigelegt werden.

1. Wenn der Platz in einem Feld nicht für alle Angaben ausreicht: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. ..." [Nummer des Feldes angeben] und machen die Angaben entsprechend der in dem Feld, in dem der Platz nicht ausreicht, vorgeschriebenen Art und Weise, insbesondere:

- (i) Wenn mehr als zwei Anmelder und/oder Erfinder vorhanden sind und kein "Fortsetzungsblatt" zur Verfügung steht: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. III" und machen für jede weitere Person die in Feld Nr. III vorgeschriebenen Angaben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.
- (ii) Wenn in Feld Nr. II oder III die Angabe "die im Zusatzfeld angegebenen Staaten" angekreuzt ist: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. II", "Fortsetzung von Feld Nr. III" bzw. "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr. III" und geben den Namen des Anmelders oder die Namen der Anmelder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf. ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Anmelder ist.
- (iii) Wenn der in Feld Nr. II oder III genannte Erfinder oder Erfinder/Anmelder nicht für alle Bestimmungsstaaten oder für die Vereinigten Staaten von Amerika als Erfinder benannt ist: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. II", "Fortsetzung von Feld Nr. III" bzw. "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr. III" und geben den Namen des Erfinders oder die Namen der Erfinder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf. ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Erfinder ist.
- (iv) Wenn zusätzlich zu dem Anwalt oder den Anwälten, die in Feld Nr. IV angegeben sind, weitere Anwälte bestellt sind: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. IV" und machen für jeden weiteren Anwalt die entsprechenden, in Feld Nr. IV vorgeschriebenen Angaben.
- (v) Wenn in Feld Nr. V bei einem Staat (oder bei OAPI) die Angabe "Zusatzpatent" oder "Zusatzzertifikat," oder wenn in Feld Nr. V bei den Vereinigten Staaten von Amerika die Angabe "Fortsetzung" oder "Teilfortsetzung" hinzugefügt wird: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. V" und geben den Namen des betreffenden Staats (oder OAPI) an und nach dem Namen jedes solchen Staats (oder OAPI) das Aktenzeichen des Hauptschutzrechts oder der Hauptschutzrechtsanmeldung und das Datum der Erteilung des Hauptschutzrechts oder der Einreichung der Hauptschutzrechtsanmeldung.
- (vi) Wenn in Feld Nr. VI die Priorität von mehr als drei früheren Anmeldungen beansprucht wird: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. VI" und machen für jede weitere frühere Anmeldung die entsprechenden, in Feld Nr. VI vorgeschriebenen Angaben.
- (vii) Wenn in Feld Nr. VI die frühere Anmeldung eine ARIPO Anmeldung ist: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. VI" und geben, unter Angabe der Nummer der Zeile, in der die frühere Anmeldung betreffenden Angaben gemacht sind, mindestens einen Staat an, der Mitglied der Pariser Verbandsübereinkunft zum Schutz des gewerblichen Eigentums ist und für den die frühere Anmeldung erfolgte.

2. Wenn, im Hinblick auf die Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen in Feld Nr. V, der Anmelder Staaten von dieser Erklärung ausnehmen möchte: In diesem Fall schreiben Sie "Bestimmung(en), die von der Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen ausgenommen ist(sind)" und geben den Namen oder den Zweibuchstaben-Code jedes so ausgeschlossenen Staates an.

3. Wenn der Anmelder für irgendein Bestimmungsamt die Vorteile nationaler Vorschriften betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit in Anspruch nimmt: In diesem Fall schreiben Sie "Erklärung betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit" und geben im folgenden die entsprechende Erklärung ab.

Fortsetzung zu Feld IV:

#### Weitere Vertreter:

Winter, Konrad T.  
Brandl, Ferdinand A.  
Furniss, Peter  
Polte, Willi M.  
Hübner, Helmut E.

Weinhold, Peter  
Stoppkotte, Cornelia  
Röss, Walter J.  
Kaiser, Jürgen  
Witz, Michael

Alois-Steinecker-Str. 22  
D-85354 Freising

# PCT

## BLATT FÜR DIE GEBÜHRENBERECHNUNG Anhang zum Antrag

Von Anmeldeamt auszufüllen

Internationales Aktenzeichen

Aktenzeichen des Anmelders  
oder Anwalts **L07853**

Eingangsstempel des Anmeldeamts

Anmelder

**LONZA AG**

### BERECHNUNG DER VORGESCHRIEBENEN GEBÜHREN

1. ÜBERMITTLUNGSGEBÜHR . . . . . EUR 102,00 **T**

2. RECHERCHENGEBÜHR . . . . . EUR 1.124,00 **S**

Die internationale Recherche ist durchzuführen von E. P. 045,00  
(Sind zwei oder mehr Internationale Recherchenbehörden für die internationale Recherche zuständig,  
ist der Name der Behörde anzugeben, die die internationale Recherche durchführen soll.)

### 3. INTERNATIONALE GEBÜHR

#### Grundgebühr

Die internationale Anmeldung enthält 25 Blätter.

umfaßt die ersten 30 Blätter . . . . . EUR 413,00 **b1**

                     x                      =                      **b2**

Anzahl der Blätter . . . . . Zusatzblattgebühr  
über 30

Addieren Sie die in Feld b1 und b2 eingetragenen  
Beträge, und tragen Sie die Summe in Feld B ein . . . . . EUR 413,00 **B**

#### Bestimmungsgebühren

Die internationale Anmeldung enthält > 10 Bestimmungen.

10 x EUR 95 = EUR 950,00 **D**

Anzahl der zu zahlenden . . . . . Bestimmungsgebühren

Bestimmungsgebühren (maximal 11)

Addieren Sie die in Feld B und D eingetragenen  
Beträge, und tragen Sie die Summe in Feld I ein . . . . . EUR 1.363,00 **I**  
(Anmelder aus einigen Staaten haben Anspruch auf eine Ermäßigung der internationalen Gebühr um 75%.  
Hat der Anmelder (oder haben alle Anmelder) einen solchen Anspruch, so beträgt der in Feld I einzutragende  
Gesamtbetrag 25% der Summe der in Feld B und D eingetragenen Beträge.)

4. GEBÜHR FÜR PRIORITÄTSBELEG (ggf.) . . . . . **P**

### 5. GESAMTBETRAG DER ZU ZAHLENDEN GEBÜHREN

Addieren Sie die in Feldern T, S, I und P eingetragenen Beträge,  
und tragen Sie die Summe in das nebenstehende Feld ein . . . . .

EUR 2.589,00

INSGESAMT

☐ Die Bestimmungsgebühren werden jetzt noch nicht gezahlt.

### ZAHLUNGSWEISE

- |   |   |  |
|---|---|--|
| <input checked="" type="checkbox"/> Abbuchungsauftrag (siehe unten) | <input type="checkbox"/> Bankwechsel    | <input type="checkbox"/> Kupons                      |
| <input type="checkbox"/> Scheck                                     | <input type="checkbox"/> Barzahlung     | <input type="checkbox"/> Sonstige (einzeln angeben): |
| <input type="checkbox"/> Postanweisung                              | <input type="checkbox"/> Gebührenmarken |  |

### ABBUCHUNGSAUFRAG (diese Zahlungsweise gibt es nicht bei allen Anmeldeämtern)

- Das Anmeldeamt EPA ☒ wird beauftragt, den vorstehend angegebenen Gesamtbetrag der Gebühren von meinem laufenden Konto abzubuchen.
- ☒ wird beauftragt, Fehlbeträge oder Überzahlungen des vorstehend angegebenen Gesamtbetrags der Gebühren meinem laufenden Konto zu belasten bzw. gutzuschreiben.
- ☐ wird beauftragt, die Gebühr für die Ausstellung des Prioritätsbelegs und seine Übermittlung an das Internationale Büro der WIPO von meinem laufenden Konto abzubuchen.

2800.0049

Kontonummer

07. Juli 1999 (07.07.1999)

Datum für Mahnung

Unterschrift C. Stoppkotte  
Dr. Cornelia Stoppkotte

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>L07853</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b> Siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA 220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5
internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 99/04814</b>	internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>08/07/1999</b>
(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>09/07/1998</b>	
Anmelder <b>LONZA AG et. al.</b>	

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt **3** Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

#### 1. Grundlage des Berichts

a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

☐ Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das

☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.

☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.

☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2. ☐ **Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen** (siehe Feld I)

3. ☐ **Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung** (siehe Feld II)

#### 4. Hinsichtlich der **Bezeichnung der Erfindung**

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt

☐ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

#### 5. Hinsichtlich der **Zusammenfassung**

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt

☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Ausendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der **Zeichnungen** ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. ☐

☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen

☐ weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat

☐ weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet

☐ keine der Abb.



## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C12P41/00 C12P17/10 C12P13/00 C12P13/02 C07C233/52

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationsymbole)

IPK 7 C12P C07C

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	CSUK, RENE ET AL: "Biocatalytical transformations. IV. Enantioselective enzymic hydrolyses o building blocks for the synthesis of carbocyclic nucleosides" TETRAHEDRON: ASYMMETRY (1994), 5(2), 269-76, 1994, XP002063687 das ganze Dokument ---	1-11
A	EVANS C T ET AL: "POTENTIAL USE OF CARBOCYCLIC NUCLEOSIDES FOR THE TREATMENT OF AIDS CHEMO-ENZYMATIC SYNTHESIS OF THE ENANTIOMERS OF CARBOVIR" JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, PERKIN TRANSACTIONS 1, Nr. 5, 1. Januar 1992 (1992-01-01), Seiten 589-592, XP002089871 ISSN: 0300-922X das ganze Dokument ---	1.8.9

-/-

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

## Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

- A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll, oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist, wie ausgeführt:
- C Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- R Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf Erfindungstätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf Erfindungstätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

S Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Aktendatum des internationalen Recherchenberichts

1. November 1999

08/11/1999

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Bevollmächtigter Beauftragter

Europäisches Patentamt, P. B. 6818 Patentan 2  
NL-1220 HV Rijswijk  
Tel. +31-70 340-2340, Tx 31-6516000  
Fax +31-70 340-8016

Delanghe, L

## C (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	US 5 688 933 A (ROBERTS STANLEY MICHAEL ET AL) 18. November 1997 (1997-11-18) Spalte 3: Ansprüche ---	1.8.9
A	WO 98 10075 A (CHIROSCIENCE LTD) 12. März 1998 (1998-03-12) Ansprüche ---	1
A	BRABBAN A ET AL: "STEREOSPECIFIC GAMMA-LACTAMASE ACTIVITY IN A PSEUDOMONAS FLUORESCENS SPECIES" JOURNAL OF INDUSTRIAL MICROBIOLOGY. Bd. 16, Nr. 1. 1. Januar 1996 (1996-01-01), Seiten 8-14. XP002048090 ISSN: 0169-4146 das ganze Dokument ---	1
A	TAYLOR S J C ET AL: "DEVELOPMENT OF THE BIOCATALYTIC RESOLUTION OF 2 -AZABICYCLO 2.2.1HEPT-5-EN-3-ONE AS AN ENTRY TO SINGLE -ENANTIOMERCARBOCYCLIC NUCLEOSIDES" TETRAHEDRON: ASYMMETRY. Bd. 4, Nr. 6, 1. Januar 1993 (1993-01-01), Seiten 1117-1128, XP002041316 ISSN: 0957-4166 das ganze Dokument ---	1
P.X	WO 99 10519 A (DAWSON MICHAEL JOHN :WALLIS CHRISTOPHER JOHN (GB): GLAXO GROUP LTD) 4. März 1999 (1999-03-04) das ganze Dokument -----	1-11

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/04814

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5688933	A	18-11-1997	US 5498625 A	12-03-1996
			AT 118208 T	15-02-1995
			DE 69016739 D	23-03-1995
			DE 69016739 T	14-06-1995
			DK 424064 T	26-06-1995
			EP 0424064 A	24-04-1991
			ES 2067693 T	01-04-1995
			GR 3015887 T	31-07-1995
			JP 2648013 B	27-08-1997
			JP 3218380 A	25-09-1991
			US 5284769 A	08-02-1996
WO 9810075	A	12-03-1998	AU 4123897 A	26-03-1998
			EP 0925361 A	30-06-1999
			ZA 9707912 A	03-09-1998
WO 9910519	A	04-03-1999	AU 9738698 A	16-03-1999